

PCT

世界知的所有権機関  
国際事務局

## 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

AO

(51) 国際特許分類 5  A61K 47/32	A1	(11) 国際公開番号  WO 94/20144
		(43) 国際公開日  1994年9月15日(15.09.94)
(21) 国際出願番号  (22) 国際出願日	PCT/JP94/00375 1994年3月9日(09. 03. 94)	(81) 指定国  CN, CZ, HU, KR, PL, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).
(30) 優先権データ  特願平5/75061	1993年3月10日(10. 03. 93) JP	添付公開書類  国際調査報告書
(71) 出願人(米国を除くすべての指定国について)  日本化薬株式会社 (NIPPON KAYAKU KABUSHIKI KAISHA)(JP/JP) 〒102 東京都千代田区富士見一丁目11番2号 Tokyo, (JP)		
(72) 発明者: および  (75) 発明者/出願人(米国についてのみ)  栗生田幸雄(AOUDA, Yukio)(JP/JP) 〒175 東京都板橋区徳丸6-17-11 Tokyo, (JP) 二宮 宏(NINOMIYA, Hiroshi)(JP/JP) 〒181 東京都三鷹市下連雀3-6-36 Tokyo, (JP) 大畠博文(OHATA, Hiroyumi)(JP/JP) 〒331 埼玉県大宮市上小町1036-2-610 Saitama, (JP)		
(74) 代理人  弁理士 井村 皓, 外(ASAMURA, Kiyoshi et al.) 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo, (JP)		

(54) Title : PASTE AND PASTE PREPARATION

(54) 発明の名称 ベースト及びベースト製剤

(57) Abstract

A paste comprising a finely powdered polyacrylic acid salt, an oleaginous base and a powdery gluten, and if necessary a powdery gelatin; and a paste preparation comprising the paste and an active ingredient. The paste and its preparation firmly adhere to the wet surface of a mucous membrane to thereby exhibit an excellent effect of protective coating and are excellent also in the stability of the active ingredient in the preparation.

(57) 要約

本発明は(1)ポリアクリル酸塩の微粉末、油性基剤及びグルテンの粉末、必要に応じて更にゼラチン粉末を配合してなるペースト、及び(2)上記ペーストに活性成分を配合してなるペースト製剤に関する。本発明によるペースト及びペースト製剤は湿潤粘膜面に強く粘着し、被覆保護性に優れるとともに、活性成分の製剤中における安定化に優れている。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AM アルメニア	CZ チェコ共和国	KP 朝鮮民主主義人民共和国	NZ ニュージーランド
AT オーストリア	DE ドイツ	KR 大韓民国	PL ポーランド
AU オーストラリア	DK デンマーク	KZ カザフスタン	PT ポルトガル
BB バルバドス	EE エストニア	LI リヒテンシュタイン	RO ルーマニア
BE ベルギー	ES スペイン	LK スリランカ	RU ロシア連邦
BF ブルキナ・ファソ	FI フィンランド	LT リトアニア	SD スーダン
BG ブルガリア	FR フランス	LU ルクセンブルグ	SE スウェーデン
BJ ベナン	GA ガボン	LV ラトヴィア	SI スロヴェニア
BR ブラジル	GB イギリス	MC モナコ	SK スロヴァキア共和国
BY ベラルーシ	GE グルジア	MD モルドバ	SN セネガル
CA カナダ	GN ギニア	MG マダガスカル	TD チャード
CF 中央アフリカ共和国	GR ギリシャ	ML マリ	TG トーゴ
CG コンゴ	HU ハンガリー	MN モンゴル	TJ タジキスタン
CH スイス	IE アイルランド	MR モーリタニア	TT トリニダード・トバゴ
CI コート・ジボアール	IT イタリー	MW マラウイ	UA ウクライナ
CM カメルーン	JP 日本	NE ニジェール	US 米国
CN 中国	KE ケニア	NL オランダ	UZ ウズベキスタン共和国
CS チェコスロバキア	KG キルギスタン	NO ノルウェー	VN ヴィエトナム

## 明細書

## ペースト及びペースト製剤

## 5 技術分野

本発明は、局所滞留性の良好なペースト及びペースト製剤に関する。

## 背景技術

これ迄に、多くの処方の粘着性軟膏が工夫されている。

10 例えば、ポリアクリル酸ナトリウム（以下PANAと言う）を油性基剤に練合し、湿润性粘膜表面への粘着により表面の保護を目的としたペースト剤、及びこれに薬物を含有した口腔製剤が知られている（特公昭56-27491、特公昭54-38168；対応U.S.P.-4, 015 59, 686）。このペースト製剤は、PANAが吸水粘稠化することにより湿润性粘膜表面に粘着するが、比較的短時間で局所での製剤の崩壊が始まるので滞留による局所粘膜表面の被覆保護性能が必ずしも十分でない面がある。

20 また、配合された活性成分の分解の少ないペースト製剤が望まれている。

## 発明の開示

本発明者らはペースト製剤の湿润性粘膜表面に対する被覆保護性能について鋭意検討した結果、油性基剤にポリアクリル酸塩の微粉末及びグルテンの粉末を同時に配

合したペースト及びペースト製剤は安定であり、製剤中の活性成分の分解も少なく、更にこの基剤にゼラチン粉末を添加して得た基剤は、口腔粘膜などの湿潤粘膜面に強く粘着し、そこで滞留することにより湿潤粘膜面の被覆保護性にすぐれることを見い出し、本発明を完成した。

本発明は（1）ポリアクリル酸塩の微粉末、グルテンの粉末及び油性基剤とからなるペースト、（2）ポリアクリル酸塩の微粉末、グルテンの粉末、ゼラチンの粉末及び油性基剤とからなるペースト、及び（3）これらのペーストが活性成分を含有することを特徴とするペースト製剤に関する。

#### 発明を実施するための最良の形態

本発明で用いられるポリアクリル酸塩としては、一般に1、2又は3価の金属イオンとポリアクリル酸との塩があげられる。好ましくはアルカリ金属塩、とりわけナトリウム塩が適している。その分子量は本発明の効果を失わない限り制限はないが、好ましくは10万～100万であり、より好ましくは20万～800万、更に好ましくは100万～600万である。30°Cにおける2N NaOH中で測定した極限粘度は0.2以上が好ましく、そのうちでも0.2～1.5 g/lが好ましく、より好ましくは0.4～1.4 g/l、更に好ましくは0.6～1.2 g/lである。平均粒子径は100メッシュ以下が好ましく、より好ましくは150メッシュ以下、更に好ましくは200メッシュ以下である。

本発明で用いられるグルテンは通常の食用に供されるものであれば特に制限はなく、その粒度は 100 メッシュ以下、より好ましくは 150 メッシュ以下である。

本発明で用いられるゼラチンの粉末としては、通常市販のものを使用することができる。ゼラチンの粘度は 6 2/3 質量 % 水溶液を用いて 60 °C で測定し、15 ~ 65 mp 程度、好ましくは 20 ~ 60 mp、より好ましくは 25 ~ 50 mp、更に好ましくは 30 ~ 40 mp である。ゼリ一強度は 6 2/3 質量 % のゼラチン水溶液を 10 °C で 16 ~ 18 時間冷却して得た検体を用いて測定し、一般に 50 ~ 500 bloom 程度、好ましくは 100 ~ 450 bloom、より好ましくは 200 ~ 400 bloom、更に好ましくは 280 ~ 350 bloom 程度である。平均粒子径はポリアクリル酸塩と同様に 100 メッシュ以下が好ましく、より好ましくは 150 メッシュ以下、更に好ましくは 200 メッシュ以下である。

次に油性基剤としては一般に医薬品製剤に用いられる物であれば特に限定は無いが、通常軟膏で使用される油性基剤が使用される。例えば炭化水素系油性基剤（ワセリン、パラフィン、流動パラフィンなど）、プラスチベース（商品名、スクイブ社製）、各種の植物又は動物由来天然油脂類、単軟膏、親水ワセリン、精製ラノリン、デキストリン脂肪酸エステル、脂肪酸グリセリド、脂肪酸、スクワラン及びラノリンアルコール等が挙げられる。

油性基剤は単独で使用しても 2 種以上併用してもよい。

通常、常温（20～30℃）でペースト状又は固体である油性基剤（以下両者まとめて固体油性基剤という）に、常温で液状である油性基剤（以下液状油性基剤という）を併用し、その固さを調整することが好ましい。好ましい組合せとして、例えば固体油性基剤としてプラスチベース、ワセリンまたはラノリンの少なくとも1種、液状油性基剤として流動パラフィン等を用いる組合せが挙げられる。固体油性基剤に対する液状油性基剤の割合は一概には決められないが、固体油性基剤100重量部（以下単に部という）に対して液状油性基剤0.05～5部程度、好ましくは0.1～2部程度、さらに好ましくは0.15～1部程度である。

本発明のペーストにおける各成分の配合重量比（以下配合比という）は以下の通りである：ポリアクリル酸塩の微粉末とグルテンの粉末の配合比は、5：95～99：1、好ましくは10：90～90：10、より好ましくは20：80～80：20とする。また、ポリアクリル酸塩の微粉末と必要に応じて配合するゼラチンの粉末の配合比は10：90～100：0、好ましくは20：80～80：20、より好ましくは30：70～70：30とする。これらの配合比の粉末混合物を油性基剤と練合する。粉末混合物の総量と油性基剤の配合比は5：95～70：30、好ましくは10：90～65：35であり、より好ましくは20：80～60：40である。

本発明のペーストの組成を下記に示す。

油性基剤 100部に対して、

ポリアクリル酸塩微粉末 約3～約80部

好ましくは 約5～約70部

5 より好ましくは 約10～約60部

グルテン粉末 約3～約50部

好ましくは 約5～約40部

より好ましくは 約10～約30部

ゼラチン粉末 0～約70部

10 好ましくは 約5～約60部

より好ましくは 約10～約50部。

本発明のペーストはそのまま傷口などの湿潤部の保護用に、また場合によっては義歯固定用の義歯安定剤として用いることもできるが、一般的には治療用薬剤などを配合するためのペースト基剤として用いられる。

本発明組成物は湿潤部位への粘着性を阻害しないよう実質的に水分を含まない方が好ましいが、通常ポリアクリル酸塩微粉末、グルテン粉末およびゼラチン粉末に由来する水分を多少含んでいる。組成物全体に対する含水量は本発明の効果を実質的に阻害しない程度、例えば約7%以下程度であれば許容される。常温で液状のアルコール類等は本発明組成物のペーストの性質に影響を与えるので一般的には含まない方が好ましい。

本発明のペースト製剤に含有せしめる活性成分としては、口腔内粘膜疾患、歯周炎等の歯科疾患に有効な薬理

活性物質、または粘膜局所からの薬剤の吸収を図る目的で全身的疾患治療薬のいずれでもよい。例えばデキサメタゾン、トリアムシノロンアセトニド、酢酸ヒドロコチゾン等の副腎皮質ホルモン、消炎鎮痛剤、消炎酵素剤、  
5 アズレン、アブリノール等の殺菌剤、ミノサイクリン等の抗生物質、ブレオマイシン等の癌化学療法剤、リドカイン等の局所麻酔剤、EGF等の血管拡張剤、鎮咳去痰剤、ニトログリセリン等の抗狭心症剤、止血剤、ホルモン剤、消化器官用剤、血糖降下剤、及び避妊剤等が挙げられる。  
10 活性成分は粉末であることが好ましく、その平均粒子径は100メッシュ以下、好ましくは150メッシュ以下、より好ましくは200メッシュ以下である。

本発明のペースト製剤における活性成分の割合は薬剤によって異なり、一概にはいえないが、有効投薬量であればよく、通常油性基剤100部に対して30部以下程度、好ましくは10部以下であり、活性成分によっては0.0001%程度でもよい。薬剤が副腎皮質ホルモンのときは例えば0.005~1部程度、好ましくは0.01~0.7部程度である。

20 本発明のペースト及びペースト製剤には、その他の添加剤としてその使用目的によって各種の高分子や界面活性剤及びリン酸塩類、尿素等を添加しても良い。例えば合成高分子としては、カルボキシビニルポリマー(B. F. Goodrich Chemical(USA)社、カーボポール®)、メチルセルロース類、エチルセルロース類、ヒドロキシメチル  
25

セルロース類、ヒドロキシプロピルメチルセルロース類、カルボキシメチルセルロース類が挙げられる。以上の高分子の平均粒子径はポリアクリル酸塩類と同様に 100 メッシュ以下、好ましくは 150 メッシュ以下、より好ましくは 200 メッシュ以下である。これら高分子化合物のペースト及びペースト製剤全体に占める割合は通常 0 ~ 20 w/w %、好ましくは 0 ~ 10 w/w % である。

本発明のペースト全体に対する各成分の割合 (w/w %) を下記に示す。

10	油性基剤	約 30 ~ 約 90 w/w % 好ましくは約 40 ~ 約 80 w/w %
	ポリアクリル酸塩微粉末	約 5 ~ 約 50 w/w % 好ましくは約 7 ~ 約 40 w/w %
	グルテン粉末	約 5 ~ 約 30 w/w % 好ましくは約 7 ~ 約 20 w/w %
15	ゼラチン粉末	約 0 ~ 約 40 w/w % 好ましくは約 6 ~ 約 30 w/w %
	その他の添加剤	0 ~ 約 20 w/w % 好ましくは 0 ~ 約 10 w/w %
20	リン酸塩類や尿素	は薬剤の安定化を目的として添加してもよく、リン酸塩としては例えばリン酸二水素カリウム、リン酸一水素カリウム、リン酸三カリウム、リン酸一水素ナトリウム、リン酸二水素ナトリウム、リン酸三ナトリウムが挙げられる。これらの添加量はペースト及びペースト製剤全体に対して通常 0 ~ 10 w/w %、好

ましくは 0 ~ 5 w/w % である。

以下、実施例を記述するに先立ち、両者を比較評価するための試験方法について述べる。

ペースト剤の性能を 1) 活性成分の安定性、 2) 引剥  
5 力及び 3) 水中でのゲル化度合の 3 つの観点から評価した。なお、引剥力の測定値は、ペースト製剤の粘膜への付着力を表す。また、水中でのゲル化度合の値はペースト製剤がゲル化して粘膜を被覆する厚さを近似的に表し、粘膜の傷口（アフタ性口内炎等）をペースト製剤が覆い  
10 クッションの役割を果たすことによって創傷等の痛みを防ぐことの指標となる。

### 1) 活性成分の安定性

ペースト剤中におけるデキサメタゾンの安定性を、 6  
5 °C 1 週間保存後の分解物の生成量を液体クロマトグラ  
15 フィーにより測定する。

### 2) 引剥力

1 cm<sup>2</sup> 当たり人工唾液 10 mg を含む不織布 2 枚の間にペースト製剤を 1 g 塗布し、 50 cm<sup>2</sup> の広さに延ばし、  
1 cm 幅ごとに切り、その一枚の片面を両面テープでレオ  
20 メーター（不動工業製 NRM - 2010 J - CW）の支持台に固定し、 15 分、 30 分、 60 分および 90 分後に引き剥がし、その力のグラム数を測定する。

### 3) ゲル化度合

複数のアクリル板にペースト製剤を一定量（厚さ 0.4  
25 mm、直徑 16 mm）塗布し、これを人工唾液中に 30 分～

3 時間浸漬し、各経時点ごとに取り出して、レオメータ  
ー（不動工業製 N R M - 2 0 1 0 J - C W）の支持台に  
乗せ、アクリル板上に形成されたペーストゲルの表面に  
スピンドルの先端をセットし、支持台を 2 cm/min の速  
度で移動してゲルに荷重をかけ、スピンドルにかかる抵  
抗力が 2 0 0 g に到達するまで（ほぼ支持台に達したと  
きまで）の時間を測定する。

以下、実施例により本発明をより詳細に説明する。

#### 例 1

擂潰機を用いてプラスチベース 5 0 W 5 9. 5 部に、デ  
キサメタゾン 0. 1 部と流動パラフィン 0. 4 部の均一混合  
物を加え、次に粒度が 1 5 0 メッシュ全通のグルテン粉  
末 1 0 部を加えて練合し、更に極限粘度値が 0. 8 6 g /  
 $\ell$  (2N-NaOH) 、粒度が 2 0 0 メッシュ全通のポリアク  
15 リル酸ナトリウムの粉末 3 0 部を加えて充分均一に練合  
後、軟膏用チューブに充てんした。活性成分の安定性と  
して分解物の生成量を測定し、その結果を表 1 に示す。

表 1

分解物の生成 (%)	
例 1	2. 2
例 2	3. 2
5 例 3	2. 8
例 4	2. 0
例 5	1. 1
例 6	1. 0
例 7	0. 9

10

## 例 2

擂潰機を用いてプラスチベース 50W 49.5 部に、デキサメタゾン 0.1 部と流動パラフィン 0.4 部の均一混合物を加え、次に粒度が 150 メッシュ全通のグルテン粉末 10 部及び粘度 32mp、ゼリー強度 327 bloom、粒度が 200 メッシュ全通のゼラチン粉末 15 部を加えて練合し、更に極限粘度値が 0.86 g/l (2N-NaOH)、粒度が 200 メッシュ全通のポリアクリル酸ナトリウムの粉末 25 部を加えて充分均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。活性成分の安定性の指標として分解物の生成量を測定し、その結果を表 1 に示す。また、本発明のペースト製剤の引剥力を測定し、その結果を表 2 に示す。

本発明のペースト製剤は、粘着性付与成分としてポリアクリル酸塩粉末のみを含むペースト製剤 (PANA 単

独配合品)に比べて2枚の不織布を引き剥がすためにより強い力を必要とし、より高い付着性を示した。

表 2

	本発明のペースト製剤 (例2)
15分	6.0 g
30分	5.3 g
60分	17.2 g
90分	20.0 g

10 ※ 6.7mm引き剥がしたとき(チャート上で6cm)の最大値

※ レオメーターの条件:

支持台「2cm/分」で下降、チャート速度「18cm/分」

15 さらに、本発明のペースト製剤のゲル化度合を測定し、その結果を表3に示す。

本発明のペースト製剤は人工唾液に浸漬後、速やかにゲル化し、ゲルに荷重をかけた時の最大荷重(200g)到達時間が、PANA単独配合品に比べてより長かった。すなわち、本発明のペースト製剤は安定なゲルの形成を示した。その結果本発明の軟膏は、PANA単独配合品に比べてより高い患部被覆性を有することがわかる。

表 3

本発明のペースト製剤 (例 2)	
5	30 分 5.1 秒
	1 時間 7.1 秒
	2 時間 10.4 秒
	3 時間 13.4 秒

※ レオメーターの条件 :

10 支持台「2 cm/分」で上昇、チャート速度「60 cm  
/分」

#### 例 3

擂潰機を用いてプラスチベース 50W 58.5 部に、デ  
キサメタゾン 0.1 部とリン酸二水素カリウム 1 部及び流  
15 動パラフィン 0.4 部の均一混合物を加え、次に粒度が 1  
50 メッシュ全通のグルテン粉末 10 部及び粘度 32 mp、  
ゼリー強度 327 bloom、粒度が 200 メッシュ全通の  
ゼラチン粉末 10 部を加えて練合し、更に極限粘度値が  
0.86 g/l (2N-NaOH)、粒度が 200 メッシュ全通  
20 のポリアクリル酸ナトリウムの粉末 20 部を加えて充分  
均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。活性成分  
の安定性として分解物の生成量を測定し、その結果を表  
1 に示す。

#### 例 4

25 擂潰機を用いてプラスチベース 50W 58.5 部に、デ

キサメタゾン0.1部と尿素1部及び流動パラフィン0.4部の均一混合物を加え、次に粒度が150メッシュ全通のグルテン粉末10部及び粘度32mp、ゼリー強度327 bloom、粒度が200メッシュ全通のゼラチン粉末150部を加えて練合し、更に極限粘度値が0.86 g/l (2N-NaOH)、粘度が200メッシュ全通のポリアクリル酸ナトリウムの粉末20部を加えて充分均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。活性成分の安定性の指標として分解物の生成量を測定し、その結果を表1に示す。

#### 10 例 5

擂潰機を用いてプラスチベース50W 59.5部に、デキサメタゾン0.1部と流動パラフィン0.4部の均一混合物を加え、次に粒度が150メッシュ全通のグルテン粉末10部及び粘度32mp、ゼリー強度327 bloom、粒度が200メッシュ全通のゼラチン粉末20部を加えて練合し、更に極限粘度値が0.86 g/l (2N-NaOH)、粘度が200メッシュ全通のポリアクリル酸ナトリウムの粉末10部を加えて充分均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。活性成分の安定性の指標として分解物20の生成量を測定し、その結果を表1に示す。

#### 例 6

擂潰機を用いてプラスチベース50W 58.5部に、デキサメタゾン0.1部とリン酸二水素カリウム1部及び流動パラフィン0.4部の均一混合物を加え、次に粒度が125部及び粘度32mp、

ゼリー強度 3 2 7 bloom、粒度が 2 0 0 メッシュ全通のゼラチン粉末 2 0 部を加えて練合し、更に極限粘度値が 0.86 g / l (2N-NaOH)、粒度が 2 0 0 メッシュ全通のポリアクリル酸ナトリウムの粉末 1 0 部を加えて充分 5 均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。活性成分の安定性の指標として分解物の生成量を測定し、その結果を表 1 に示す。

#### 例 7

擂潰機を用いてプラスチベース 5 0 W 58.5 部に、デ 10 キサメタゾン 0.1 部と尿素 1 部及び流動パラフィン 0.4 部の均一混合物を加え、次に粒度が 1 5 0 メッシュ全通のグルテン粉末 1 0 部及び粘度 3 2 mp、ゼリー強度 3 2 7 bloom、粒度が 2 0 0 メッシュ全通のゼラチン粉末 2 0 部を加えて練合し、更に極限粘度値が 0.86 g / l 15 (2N-NaOH)、粒度が 2 0 0 メッシュ全通のポリアクリル酸ナトリウムの粉末 1 0 部を加えて充分均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。活性成分の安定性の指標として分解物の生成量を測定し、その結果を表 1 に示す。

#### 例 8

擂潰機を用いてプラスチベース 5 0 W 49.5 部に、デ 20 キサメタゾン 0.1 部と流動パラフィン 0.4 部の均一混合物を加え、次に粘度 3 7 mp、ゼリー強度 3 0 6 bloom、粒度が 1 5 0 メッシュ全通のゼラチン粉末 1 6 部と粒度が 1 5 0 メッシュ全通のカルボキシメチルセルロースナ 25 トリウム (セロゲン H P - 3 H S) 4 部及び粒度が 1 5

0 メッシュ全通のグルテン粉末 10 部を加えて練合し、更に極限粘度値が 0.95 g / l (2N-NaOH) 、粒度が 200 メッシュ全通のポリアクリル酸ナトリウムの粉末 20 部を加えて充分均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。

例 9

擂潰機を用いて白色ワセリン 59.5 部にトリアムシノロンアセトニド 0.1 部と流動パラフィン 0.4 部の均一混合物を加え、次に粘度 37 mp 、ゼリー強度 306 bloom 、粒度が 100 メッシュ全通のゼラチン粉末 10 部と粒度が 150 メッシュ全通のグルテン 10 部を加えて練合し、更に極限粘度値が 0.95 g / l (2N-NaOH) 、粒度が 150 メッシュ全通のポリアクリル酸ナトリウムの粉末 20 部を加えて充分均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。

例 10

擂潰機を用いてプラスチベース 50W 50 部に酢酸ヒドロコーチゾン 0.1 部と流動パラフィン 0.4 部の均一混合物を加え、次に粒度 32 mp 、ゼリー強度 327 bloom 、粒度が 200 メッシュ全通のゼラチン粉末 19.5 部と粒度が 150 メッシュ全通のグルテン粉末 10 部を加えて練合し、更に極限粘度値が 0.95 g / l (2N-NaOH) 、粒度が 150 メッシュ全通のポリアクリル酸ナトリウムの粉末 20 部を加えて充分均一に練合後、軟膏用チューブに充てんした。

### 産業上の利用可能性

本発明のペースト製剤は活性成分（デキサメタゾン等）の分解が少なく、付着性が高く、また、ゲル化度合も高いので、薬剤が粘膜に良好に付着し、かつ粘膜の傷口を被覆することにより痛み等を防ぐことに役立つ。従って本発明は多くの処方の粘着性軟膏に利用することができる。

## 請 求 の 範 囲

1. ポリアクリル酸塩の微粉末、グルテンの粉末及び油性基剤を含むペースト。
- 5 2. さらにゼラチンの粉末を含む請求項1記載のペースト。
3. 請求項1に記載されたペースト及び活性成分を含むペースト製剤。
4. 請求項2に記載されたペースト及び活性成分を含むペースト製剤。
- 10 5. ポリアクリル酸塩の微粉末3～80重量部、グルテンの粉末3～50重量部及び油性基剤100重量部を含む請求項1記載のペースト。
6. ポリアクリル酸塩の微粉末5～70重量部、グルテンの粉末5～40重量部、ゼラチンの粉末5～60重量部及び油性基剤100重量部を含む請求項2記載のペースト。
- 15 7. ペースト全体に対して、5～50w/w%のポリアクリル酸塩の微粉末、5～30w/w%のグルテンの粉末、30～90w/w%の油性基剤及び0～20w/w%のその他の添加剤よりなる請求項1記載のペースト。
- 20 8. ペースト全体に対して、5～50w/w%のポリアクリル酸塩の微粉末、5～30w/w%のグルテンの粉末、40w/w%以下のゼラチンの粉末、30～90w/w%の油性基剤、及び0～20w/w%のその他の

添加剤よりなる請求項 2 記載のペースト。

9. ペースト全体に対して、7～40 w/w % のポリアクリル酸塩の微粉末、7～20 w/w % のグルテンの粉末、6～30 w/w % のゼラチンの粉末、0～10 w  
5 /w % のその他の添加剤、及び40～80 w/w % の油性基剤よりなる請求項 2 記載のペースト。

10. ポリアクリル酸塩が分子量10万～1000万のホリアクリル酸ナトリウムである請求項 1 又は 2 記載のペースト。

10 11. 油性基剤として、プラスチベース、ワセリン及びラノリンからなる群より選ばれる少なくとも 1 種、ならびに流動パラフィンを併用する請求項 1 又は 2 記載のペースト。

15 12. 活性成分を油性基剤 100 重量部に対し、30 重量部以下の量で含有する請求項 3 又は 4 記載のペースト製剤。

13. 活性成分が副腎皮質ホルモンであり、該活性成分を油性基剤 100 重量部に対し 0.005～1 重量部の量で含有する請求項 1 2 記載のペースト製剤。

20 14. 副腎皮質ホルモンがデキサメタゾンである請求項 1 3 記載のペースト製剤。

15. ポリアクリル酸塩の微粉末の粒子径が 100 メッシュ以下、グルテンの粉末の粒子径が 100 メッシュ以下、ゼラチンの粉末の粒子径が 100 メッシュ以下であり、ゼリー強度が 50～500 bloom である、請求項 2  
25

記載のペースト。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP94/00375

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl<sup>5</sup> A61K47/32

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl<sup>5</sup> A61K47/32, A61K47/36

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, A, 53-86011 (Nippon Kayaku Co., Ltd.), July 29, 1978 (29. 07. 78), Lines 4 to 5, lower left column, page 1 & US, A, 4,059,686	1-15

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

## \* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

April 15, 1994 (15. 04. 94)

Date of mailing of the international search report

April 26, 1994 (26. 04. 94)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Facsimile No.

Authorized officer

Telephone No.

## A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. CL<sup>a</sup> A 61 K 47/32

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. CL<sup>a</sup> A 61 K 47/32, A 61 K 47/36

## 最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

## 国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP, A, 53-86011 (日本化薬株式会社), 29. 7月. 1978 (29. 07. 78), 第1頁左下欄, 第4行—第5行 & US, A, 4,059,686	1-15

 C欄の続きをも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
 「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの  
 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日  
     若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献  
     (理由を付す)  
 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  
 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日  
     の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と  
     矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のため  
     に引用するもの  
 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規  
     性又は進歩性がないと考えられるもの  
 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文  
     献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性  
     がないと考えられるもの  
 「&」同一パテントファミリー文献

## 国際調査を完了した日

15. 04. 94

## 国際調査報告の発送日

26.04.94

## 名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

## 特許庁審査官(権限のある職員)

弘 實 謙 二

4 C 7 4 3 3

電話番号 03-3581-1101 内線 3452